

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 9 月 9 日 (09.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/082840 A1(51) 国際特許分類: C07C 241/02, 227/04, 227/18,  
229/08, 243/38 // C07B 61/00, C07M 7:00(74) 代理人: 佐伯 憲生 (SAEKI, Norio); 〒1030027 東京都  
中央区日本橋三丁目 15 番 8 号 アミノ酸会館ビル  
4 階 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002981

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) 国際出願日: 2005 年 2 月 24 日 (24.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-056877 2004 年 3 月 1 日 (01.03.2004) JP  
特願2004-244685 2004 年 8 月 25 日 (25.08.2004) JP(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,  
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 独立  
行政法人科学技術振興機構 (JAPAN SCIENCE AND  
TECHNOLOGY AGENCY) [JP/JP]; 〒3320012 埼玉県  
川口市本町 4 丁目 1 番 8 号 Saitama (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小林 修  
(KOBAYASHI, Shu) [JP/JP]; 〒1010048 東京都千代田  
区神田司町 2-19 Tokyo (JP). 杉浦 正晴 (SUGIURA,  
Masaharu) [JP/JP]; 〒2360057 神奈川県横浜市金沢区  
能見台 6-11-5 藤井方 Kanagawa (JP).

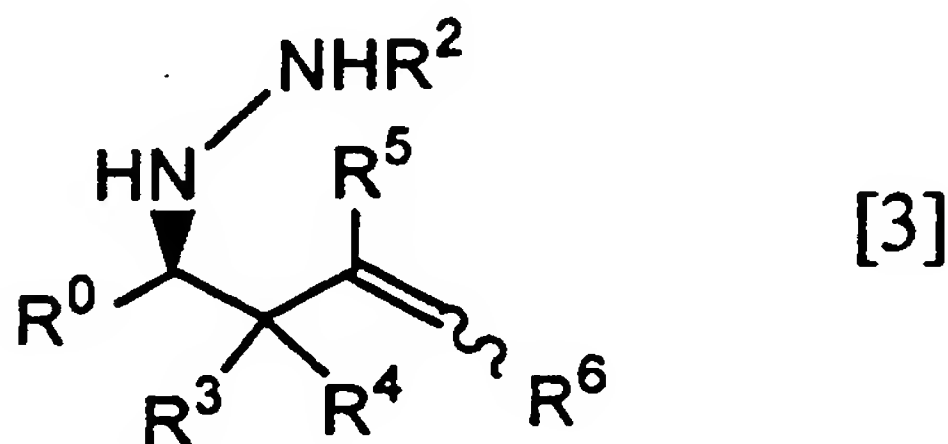
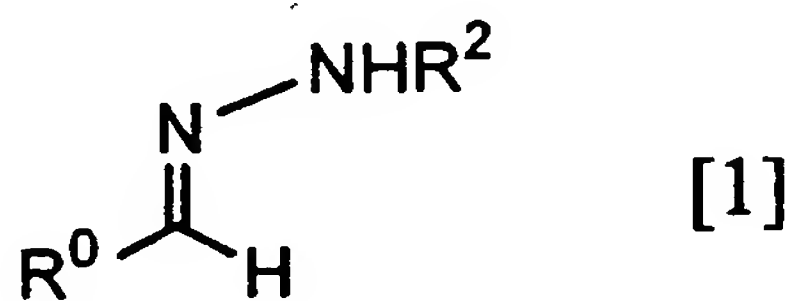
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR THE ALLYLATION OF N-ACYLHYDRAZONES

(54) 発明の名称: N-アシルヒドラゾンのアリル化方法

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a novel process for  
the allylation of N-acylhydrazones by which enantioselectively  
allylated N-acylhydrazines can be efficiently obtained.  
[MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] A process for the  
production of enantioselectively allylated N-acylhydrazines  
represented by the general formula [3]: [3] [wherein R<sup>0</sup> is  
an optionally substituted hydrocarbon group, an optionally  
substituted heterocyclic group, or -COOR<sup>1</sup> (wherein R<sup>1</sup>  
is a hydrocarbon group); R<sup>2</sup> is acyl; R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> are each  
hydrogen, or one of R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> is hydrogen and the other is  
a hydrocarbon group; and R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> are each independently  
hydrogen or a hydrocarbon group], characterized by reacting  
an N-acylhydrazone represented by the general formula [1]:  
[1] [wherein R<sup>0</sup> and R<sup>2</sup> are as defined above] with an allylating  
agent such as allyltrichlorosilane or crotyltrichlorosilane in the  
presence of a chiral phosphine oxide.

[続葉有]

WO 2005/082840 A1

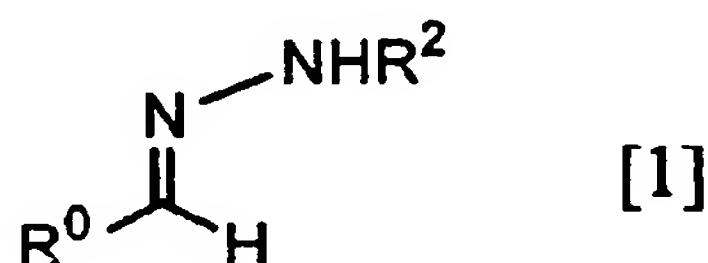


(57) 要約:

【課題】エナンチオ選択的にアリル化されたN-アシルヒドラゾンが効率的に得られる、新規なN-アシルヒドラジンのアリル化方法の提供。

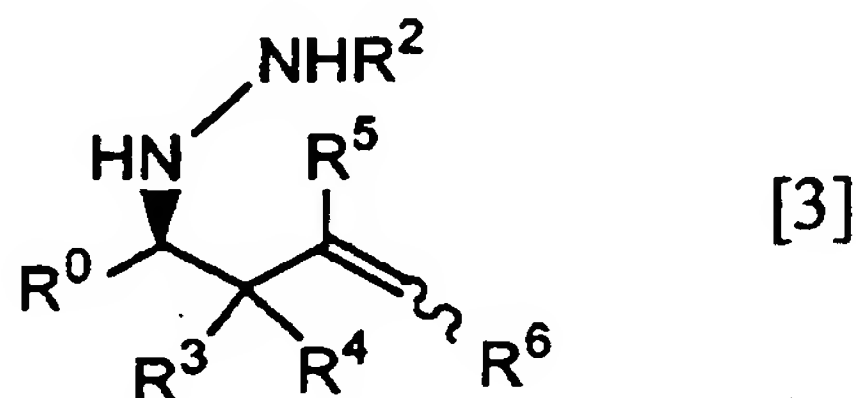
【解決手段】一般式[1]

【化23】



[式中、 $\text{R}^0$ は置換基を有していてもよい炭化水素基、同複素環基又は $-\text{COOR}^1$  (但し、 $\text{R}^1$ は炭化水素基を表す。)を表し、 $\text{R}^2$ はアシル基を表す。]で示されるN-アシルヒドラゾンと、例えば、アリルトリクロロシランやクロチルトリクロロシラン等のアリル化試薬とを、キラルホスフィンオキシド類の存在下で反応させることを特徴とする、一般式[3]

【化24】



(式中、 $\text{R}^0$ 及び $\text{R}^2$ は前記と同じ。 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ は共に水素原子を表すか、或いは一方が水素原子で、他方は炭化水素基を表す。 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^6$ はそれぞれ独立して水素原子又は炭化水素基を表す。)で示される、エナンチオ選択的にアリル化されたN-アシルヒドラジンの製造法。